

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年3月10日 (10.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/020882 A2

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012768
- (22) 国際出願日: 2004年8月27日 (27.08.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
- |               |                         |    |
|---------------|-------------------------|----|
| 特願2003-306088 | 2003年8月29日 (29.08.2003) | JP |
| 特願2004-110573 | 2004年4月2日 (02.04.2004)  | JP |
| 特願2004-169958 | 2004年6月8日 (08.06.2004)  | JP |
| 特願2004-198523 | 2004年7月5日 (05.07.2004)  | JP |

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府大阪市中央区道修町2丁目1番5号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中出 眞嗣 (NAKADE, Shinji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 水野 弘貴 (MIZUNO, Hirotaka) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小野 岳児 (ONO, Takeji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 南 真志 (MINAMI, Masashi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 佐賀 寛 (SAGA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株

式会社内 Ibaraki (JP). 萩谷 洋 (HAGIYA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小宮 貴樹 (KOMIYA, Takaki) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県つくば市和台17番地2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 巾下 広 (HABASHITA, Hiromu) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 倉田 晴登 (KURATA, Haruto) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 大槻 和裕 (OHTSUKI, Kazuhiro) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 久須美 健介 (KUSUMI, Kensuke) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府三島郡島本町桜井三丁目1番1号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP).

(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町2丁目14番6号 セルバ人形町6階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

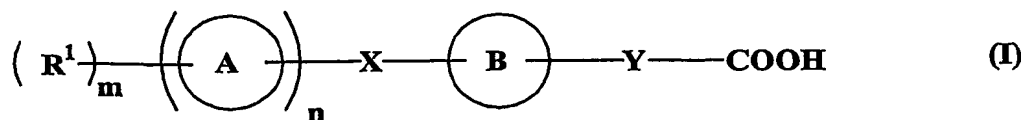
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

[続葉有]

(54) Title: COMPOUND CAPABLE OF BINDING S1P RECEPTOR AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: S1P受容体結合能を有する化合物およびその医薬用途



(57) Abstract: A compound capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6). For example, a compound of the general formula (I), its salt or solvate, or a prodrug thereof is capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6) and is thus useful in the prevention and/or treatment of immunological reaction to transplant, graft versus host disease, autoimmune disease, allergosis, etc. (I) (wherein the ring A is a cyclic group; the ring B is an optionally substituted cyclic group; X is a spacer with a main chain of 1 to 8 atoms, etc.; Y is a spacer with a main chain of 1 to 10 atoms, etc.; and n is 0 or 1 provided that when n is 0, m is 1 and R<sup>1</sup> is a hydrogen atom or a substituent and that when n is 1, m is 0 or an integer of 1 to 7 and R<sup>1</sup> is a substituent, in which when m is 2 or greater, R<sup>1</sup>s may be identical with or different from each other).

[続葉有]



CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

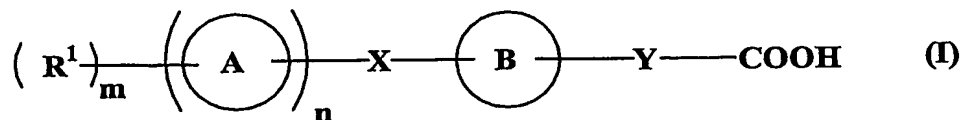
2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

- 国際調査報告書なし；報告書を受け取り次第公開される。

(57) 要約:

S 1 P受容体（特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6）結合能を有する化合物、例えば一般式（I）で示される本発明化合物、その塩、その溶媒和物、またはそれらのプロドラッグはS 1 P受容体（特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6）結合能を有し、移植に対する拒絶反応、移植片対宿主病、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患等の予防および／または治療に有用である。



（式中、環Aは環状基；環Bは置換基を有していてもよい環状基；Xは主鎖の原子数1～8のスペーサー等；Yは主鎖の原子数1～10のスペーサー等；nは0、1；nが0の場合、mは1、かつR<sup>1</sup>は水素原子、置換基；nが1の場合、mは0、1～7の整数、かつR<sup>1</sup>は置換基、かつmが2以上のときR<sup>1</sup>は同じでも異なってもよい）。